

## PATENT COOPERATION TREATY

PCT

## NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Assistant Commissioner for Patents  
United States Patent and Trademark  
Office  
Box PCT  
Washington, D.C. 20231  
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing: 02 November 2000 (02.11.00)	
International application No.: PCT/EP00/03612	Applicant's or agent's file reference: E 7518/WM
International filing date: 20 April 2000 (20.04.00)	Priority date: 22 April 1999 (22.04.99)
Applicant: REIN, Hubert et al	

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International preliminary Examining Authority on:  
27 September 2000 (27.09.00)☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:  
\_\_\_\_\_2. The election ☒ was  
☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No.: (41-22) 740.14.35	Authorized officer: J. Zahra Telephone No.: (41-22) 338.83.38
---	---

# VERTEILUNG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>E 7518/WM</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 00/ 03612</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>20/04/2000</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>22/04/1999</b>
Anmelder  <b>EUROCELTIQUE S.A.</b>		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

#### 1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.

☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

#### 4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

#### 5. Hinsichtlich der Zusammenfassung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. \_\_\_\_\_

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

☒ keine der Abb.

**A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**

IPK 7 A61K9/20

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 92 15285 A (WARNER LAMBERT CO) 17. September 1992 (1992-09-17) Seite 11, Zeile 8 -Seite 14, Zeile 25 Seite 17, Zeile 34 -Seite 18, Zeile 15 Seite 23, Zeile 35 -Seite 27, Zeile 21 Seite 28, Zeile 4 -Seite 30, Zeile 21; Beispiel 1 Abbildungen 1-3,5,6 Seite 34, Zeile 15 -Seite 35, Zeile 18 Abbildung 10 Ansprüche 1-41 ---	1-19
X	US 4 612 009 A (DROBNIK JAROSLAV ET AL) 16. September 1986 (1986-09-16) Spalte 1, Zeile 67 -Spalte 2, Zeile 5 Spalte 2, Zeile 63 -Spalte 3, Zeile 26; Beispiel 1 ---	1,4,11, 13
	---	
	-/--	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindnerischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindnerischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

29. September 2000

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

06/10/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Muller, S

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 10762 A (NAPPER JAMES ALBERT ;ROUSSEAU LAURENCE (GB); SMITHKLINE BEECHAM PL) 19. März 1998 (1998-03-19) Seite 9; Beispiel 4 -----	1,10

# INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichung, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/03612

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9215285 A	17-09-1992	AU 1589492 A	06-10-1992
US 4612009 A	16-09-1986	CH 671337 A	31-08-1989
		DE 3521893 A	19-12-1985
		GB 2160422 A, B	24-12-1985
WO 9810762 A	19-03-1998	AU 4128897 A	02-04-1998
		BR 9711734 A	24-08-1999
		CN 1235544 A	17-11-1999
		CZ 9900832 A	11-08-1999
		EP 0929301 A	21-07-1999
		NO 991194 A	11-03-1999
		PL 332074 A	30-08-1999
		ZA 9708133 A	12-04-1999

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 00/03612

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A61K9/20

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 92 15285 A (WARNER LAMBERT CO) 17 September 1992 (1992-09-17) page 11, line 8 -page 14, line 25 page 17, line 34 -page 18, line 15 page 23, line 35 -page 27, line 21 page 28, line 4 -page 30, line 21; example 1 figures 1-3,5,6 page 34, line 15 -page 35, line 18 figure 10 claims 1-41	1-19
X	US 4 612 009 A (DROBNIK JAROSLAV ET AL) 16 September 1986 (1986-09-16) column 1, line 67 -column 2, line 5 column 2, line 63 -column 3, line 26; example 1	1,4,11,13

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"B" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 September 2000

Date of mailing of the international search report

06/10/2000

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax (+31-70) 340-3018

Authorized officer

Muller, S

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int. Application No.  
PCT/EP 00/03612

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 98 10762 A (NAPPER JAMES ALBERT ; ROUSSEAU LAURENCE (GB); SMITHKLINE BEECHAM PL) 19 March 1998 (1998-03-19) page 9; example 4	1, 10

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/03612

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 9215285	A	17-09-1992	AU	1589492 A	06-10-1992
US 4612009	A	16-09-1986	CH	671337 A	31-08-1989
			DE	3521893 A	19-12-1985
			GB	2160422 A,B	24-12-1985
WO 9810762	A	19-03-1998	AU	4128897 A	02-04-1998
			BR	9711734 A	24-08-1999
			CN	1235544 A	17-11-1999
			CZ	9900832 A	11-08-1999
			EP	0929301 A	21-07-1999
			NO	991194 A	11-03-1999
			PL	332074 A	30-08-1999
			ZA	9708133 A	12-04-1999

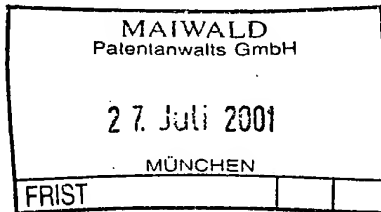


# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: MIT DER INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNG BEAUFTRAGTE BEHÖRDE

An:

MAIWALD, Walter  
MAIWALD GMBH  
Elisenhof  
Elisenstrasse 3  
D-80335 München  
ALLEMAGNE



## PCT

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG  
DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNGSBERICHTS  
(Regel 71.1 PCT)

Absendedatum  
(Tag/Monat/Jahr) 26.07.2001

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts  
E 7518/WM

### WICHTIGE MITTEILUNG

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP00/03612

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)  
20/04/2000

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)  
22/04/1999

Anmelder  
EUROCELTIQUE S.A. et al.

1. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
2. Eine Kopie des Berichts wird - gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen - dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
3. Auf Wunsch eines ausgewählten Amtes wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.


#### 4. ERINNERUNG

Zum Eintritt in die nationale Phase hat der Anmelder vor jedem ausgewählten Amt innerhalb von 30 Monaten ab dem Prioritätsdatum (oder in manchen Ämtern noch später) bestimmte Handlungen (Einreichung von Übersetzungen und Entrichtung nationaler Gebühren) vorzunehmen (Artikel 39 (1)) (siehe auch die durch das Internationale Büro im Formblatt PCT/IB/301 übermittelte Information).

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Prüfungsbericht enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu den maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde

 Europäisches Patentamt  
D-80298 München  
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d  
Fax: +49 89 2399 - 4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Longo, E

Tel. +49 89 2399-8141




# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>E 7518/WM</b>		<b>WEITERES VORGEHEN</b>		siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP00/03612</b>		Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>20/04/2000</b>		Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) <b>22/04/1999</b>
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK <b>A61K9/20</b>				
Anmelder <b>EUROCELTIQUE S.A. et al.</b>				
<p>1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).</p> <p>Diese Anlagen umfassen insgesamt 1 Blätter.</p>				
<p>3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>I <input checked="" type="checkbox"/> Grundlage des Berichts</li> <li>II <input type="checkbox"/> Priorität</li> <li>III <input type="checkbox"/> Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</li> <li>IV <input type="checkbox"/> Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</li> <li>V <input checked="" type="checkbox"/> Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</li> <li>VI <input type="checkbox"/> Bestimmte angeführte Unterlagen</li> <li>VII <input type="checkbox"/> Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</li> <li>VIII <input checked="" type="checkbox"/> Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</li> </ul>				
Datum der Einreichung des Antrags  <b>27/09/2000</b>		Datum der Fertigstellung dieses Berichts  <b>26.07.2001</b>		
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465		Bevollmächtigter Bediensteter  <b>Pregetter, M</b>  Tel. Nr. +49 89 2399 8719		



**I. Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):  
**Beschreibung, Seiten:**

1-13                      ursprüngliche Fassung

**Patentansprüche, Nr.:**

2-8,11-17,19            ursprüngliche Fassung

1,9,10,18              eingegangen am                      02/05/2001    mit Schreiben vom    30/04/2001

**Zeichnungen, Blätter:**

1/6-6/6                      ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/03612

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,      Seiten:
- ☐ Ansprüche,      Nr.:
- ☐ Zeichnungen,      Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).*

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

## V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

### 1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	3,5,12,14
	Nein: Ansprüche	1,2,4,6-11,13,15-19
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	3,5,12,14
	Nein: Ansprüche	1,2,4,6-11,13,15-19
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-19
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen  
siehe Beiblatt

## VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:  
siehe Beiblatt

**Zu Punkt V**

Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

D1: WO-92 15285 A (WARNER LAMBERT CO) 17. September 1992 (1992-09-17)

D2: US-A-4 612 009 (DROBNIK JAROSLAV ET AL) 16. September 1986 (1986-09-16)

D3: WO 98 10762 A (NAPPER JAMES ALBERT ;ROUSSEAU LAURENCE (GB); SMITHKLINE BEECHAM PL) 19. März 1998 (1998-03-19)

- 2.1. Der Gegenstand des Anspruchs 1 ist nicht neu gemäß Artikel 33(2) PCT.

Dokument D1 offenbart bereits ein Verfahren zur Herstellung von Arzneiformen oder deren Vorstufen mittels Extrusion wobei der Schritt der Extrusion und die dabei gewählten Parameter die Eigenschaften der auf Polysacchariden basierenden Matrix beeinflussen, z.B. durch Erzielen einer porösen Matrix (Beispiel 18).

Dokument D3 offenbart die Extrusion einer Matrix die ein Gemisch von Laktose und Avicel PH 1010, sowie eine pharmazeutisch wirksame Substanz enthält (Beispiel 3). Durch das Erzeugen eines Granulats (pellets) wird ein homogenes Vorliegen des Wirkstoffes in der Endformulierung erreicht. Durch die homogene Vermischung des Wirkstoffes mit der Matrix wird zwangsläufig ein bestimmtes Freisetzungsprofil erreicht, welches sich von dem einer inhomogenen Formulierung unterscheidet.

- 2.2. Die abhängigen Ansprüche 2, 4, 6, 7, 8, 9 enthalten keine Merkmale, die in Kombination mit den Merkmalen irgendeines Anspruchs, auf den sie sich beziehen, die Erfordernisse des PCT in bezug auf Neuheit bzw. erfinderische Tätigkeit gegenüber D1-D3 erfüllen.

- 2.3. Keines der im Recherchenbericht zitierten Dokumente offenbart ein Verfahren um eine amorphe oder teilamorphe Matrix, die einen pharmazeutischen Wirkstoff

enthält, zu erhalten. Wasserunlösliche Matrizen auf Polysaccharidbasis werden nicht erwähnt.

D1 wird als nächster Stand der Technik angesehen. Dieses Dokument beschreibt die Verarbeitung einer Matrix auf Stärkebasis, die bei Temperaturen zwischen 80 und 240°C extrudiert wird (Anspruch 1). Es wird ein Verfahren beansprucht bei dem zuerst die Stärke extrudiert wird, danach wird der Wirkstoff beigemischt (Anspruch 25).

Beispiel 18 offenbart eine gemeinsame Extrusion von Wirkstoff und Stärke. Das nach der Extrusion erhaltenen Produkt liegt in aufgeschäumter Form vor.

Die bevorzugten Extrusionstemperaturen liegen alle über 100°C, die Herstellung eines amorphen oder teilamorphen Produkts wird nicht nahegelegt.

3. Der Gegenstand der Ansprüche 10,11,13,15-18 ist nicht neu gemäß Artikel 33(2) PCT.

Es gelten sinngemäß die unter 2.1. - 2.3. erhobenen Einwände.

4. Der Gegenstand des Anspruchs 19 ist nicht neu gemäß Artikel 33(2) PCT.

Das Dokument D1 beschreibt bereits die Verwendung der durch die in 2.1. und 2.2. beschriebenen Verfahrenen erhaltenen Arzneiformen zur Herstellung einer breiten Palette von Dosierformen (S.26, Z.29 - S.27, Z.21).

### **Zu Punkt VIII**

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

- 1.1. Der Gegenstand des Anspruchs 1 definiert ein Verfahren zur Herstellung von Arzneiformen oder Vorstufen davon.

Aus der Beschreibung auf Seite 7, Z.1-7 geht hervor, daß die folgenden Merkmale für die Definition der Erfindung wesentlich sind:

Die Extrusionsparameter müssen derart gewählt werden, daß folgende Eigenschaften der Arzneiform oder ihrer Vorstufe erhalten werden:

- (1) amorphe oder teilamorphe Matrix
- (2) quellbare und wasserunlösliche Matrix

Da der unabhängige Anspruch 1 diese Merkmale nicht enthält, entspricht er nicht dem Erfordernis des Artikels 6 PCT in Verbindung mit Regel 6.3 b) PCT, daß

jeder unabhängige Anspruch alle technischen Merkmale enthalten muß, die für die Definition der Erfindung wesentlich sind.

Der gleiche Einwand gilt auch für die Ansprüche 10 und 19.

- 1.2. Außerdem hat der Begriff "wesentliche Eigenschaften" keine klar umrissene Bedeutung. Prinzipiell können relative Begriffe (wesentlich) nicht verwendet werden um ein technisches Merkmal von dem Stand der Technik abzugrenzen.
- 1.3. Die "Eigenschaften" einer Matrix können vielgestaltig sein. Sowohl physikalische Parameter (z.B. Dichte, Kristallinität, Schmelztemperatur) mögliche Arzneimittelfreisetzungsprofile als auch chemische Parameter (z.B. Oxidationsgrad, Kettenlänge und/oder Verzweigungsgrad von Polymeren) sind Eigenschaften einer Matrix. Jede durchgeführte Extrusion wird einige Eigenschaften der Matrix verändern
- 1.4. Der Anspruch 1 entspricht nicht den Erfordernissen des Artikels 6 PCT, weil der Gegenstand des Schutzbegehrens nicht klar definiert ist. In dem Anspruch wird versucht, den Gegenstand durch das zu erreichende Ergebnis zu definieren; damit wird aber lediglich die zu lösende Aufgabe angegeben.

PCT/EP00/03612

30. April 2001

EUROCELTIQUE S.A.

### Ansprüche

1. Verfahren zur Herstellung von Arzneiformen oder Vorstufen davon mittels Extrusion,  
**dadurch gekennzeichnet**, daß die Arzneiform eine den Wirkstoffgehalt im wesentlichen enthaltende Matrix aufweist, die ein Polysaccharid und/oder ein Derivat davon und/oder einen Komplex davon und/oder eine beliebige Mischung der vorgenannten Substanzen mit anderen Substanzen und/oder Sacchariden und/oder Derivaten davon als wesentlichen Bestandteil der Matrix sowie mindestens einen pharmazeutischen Wirkstoff umfaßt und in ihren wesentlichen Eigenschaften hinsichtlich der Freisetzung des Wirkstoffs durch Extrusion zusammen mit dem Wirkstoff ausgebildet wird.

9. Verfahren nach einem der vorangehenden Ansprüche,  
**dadurch gekennzeichnet**, daß mindestens ein pharmazeutischer Wirkstoff in gelöster, fester oder flüssiger Form in der Matrix vorliegt.

10. Arzneiform, umfassend eine den Wirkstoffgehalt im wesentlichen enthaltende Matrix, die ein Polysaccharid und/oder ein Derivat davon und/oder einen Komplex davon und/oder eine beliebige Mischung der vorgenannten Substanzen mit anderen Substanzen und/oder Sacchariden und/oder Derivaten davon als wesentlichen Bestandteil der Matrix sowie mindestens einen pharmazeutischen Wirkstoff umfaßt und in ihren wesentlichen Eigenschaften hinsichtlich der Freisetzung des Wirkstoffs durch Extrusion zusammen mit dem Wirkstoff ausgebildet ist.

18. Arzneiform nach einem der Ansprüche 10 bis 17,  
**dadurch gekennzeichnet**, daß mindestens ein pharmazeutischer Wirkstoff in gelöster, fester oder flüssiger Form in der Matrix vorliegt.

WM:HG:mb



**Translation**

**PATENT COOPERATION TREATY**

**PCT**

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference <b>E 7518/WM</b>	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. <b>PCT/EP00/03612</b>	International filing date (day/month/year) <b>20 April 2000 (20.04.00)</b>	Priority date (day/month/year) <b>22 April 1999 (22.04.99)</b>
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC <b>A61K 9/20</b>		
Applicant <b>EUROCELTIQUE S.A.</b>		

<p>1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).</p> <p>These annexes consist of a total of <u>1</u> sheets.</p>	
<p>3. This report contains indications relating to the following items:</p> <p>I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report</p> <p>II <input type="checkbox"/> Priority</p> <p>III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p>IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of invention</p> <p>V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p>VI <input type="checkbox"/> Certain documents cited</p> <p>VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application</p> <p>VIII <input checked="" type="checkbox"/> Certain observations on the international application</p>	

Date of submission of the demand <b>27 September 2000 (27.09.00)</b>	Date of completion of this report <b>26 July 2001 (26.07.2001)</b>
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP00/03612

## I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.*):

- ☒ the international application as originally filed.
- ☒ the description, pages 1-13, as originally filed,  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.
- ☒ the claims, Nos. 2-8,11-17,19, as originally filed,  
 Nos. \_\_\_\_\_, as amended under Article 19,  
 Nos. \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
 Nos. 1,9,10,18, filed with the letter of 30 April 2001 (30.04.2001),  
 Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.
- ☒ the drawings, sheets/fig 1/6-6/6, as originally filed,  
 sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
 sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
 sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

**V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement****1. Statement**

Novelty (N)	Claims	3, 5, 12, 14	YES
	Claims	1, 2, 4, 6-11, 13, 15-19	NO
Inventive step (IS)	Claims	3, 5, 12, 14	YES
	Claims	1, 2, 4, 6-11, 13, 15-19	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-19	YES
	Claims		NO

**2. Citations and explanations**

1. This report makes reference to the following documents:

D1: WO-A-92/15285 (WARNER LAMBERT CO), 17 September 1992 (1992-09-17)

D2: US-A-4 612 009 (DROBNIK JAROSLAV ET AL), 16 September 1986 (1986-09-16)

D3: WO-A-98/10762 (NAPPER JAMES ALBERT; ROUSSEAU LAURENCE (GB); SMITHKLINE BEECHAM PL), 19 March 1998 (1998-03-19).

- 2.1 The subject matter of Claim 1 is not novel within the meaning of PCT Article 33(2). Document D1 already discloses a method for producing medical preparations or their precursors by means of extrusion, the extrusion step and associated selected parameters having an effect on the properties of the matrix based on polysaccharides, for example in that a porous matrix is obtained (Claim 18).

Document D3 discloses the extrusion of a matrix which contains a mixture of lactose and Avicel PH

1010 and a pharmaceutically active substance (Example 3). Through the production of a granulate (pellets) the active ingredient is present homogeneously in the final formulation. Homogeneous mixing of the active ingredient with the matrix invariably results in a defined release profile which differs from that of an inhomogeneous formulation.

2.2 Dependent Claims 2, 4, 6, 7, 8 and 9 contain no features which, combined with the features of any claim to which they refer, meet the PCT requirements for novelty and inventive step with respect to D1-D3.

2.3 None of the search report citations discloses a method for obtaining an amorphous or partly amorphous matrix containing a pharmaceutical active ingredient. Water insoluble matrices on a polysaccharide basis are not mentioned.

D1 is considered the closest prior art. It describes the processing of a matrix on a starch basis which is extruded at between 80 and 240 °C (Claim 1). A method is claimed according to which the starch is extruded first and then the active ingredient admixed (Claim 25).

Claim 18 discloses the joint extrusion of active ingredient and starch. The product obtained after extrusion is present in foamed form. All the preferred extrusion temperatures are higher than 100 °C; the production of an amorphous or partly amorphous product is not suggested.

3. The subject matter of Claims 10, 11, 13 and 15-18 is not novel within the meaning of PCT Article 33(2). The objections raised under items 2.1 to 2.3 above apply analogously.
4. The subject matter of Claim 19 is not novel within the meaning of PCT Article 33(2). Document D1 already describes the use of the medical preparations obtained by means of the methods described in items 2.1 and 2.2 above for the production of a broad range of dosage forms (page 26, line 29, to page 27, line 21).

**VIII. Certain observations on the international application**

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

- 1.1 The subject matter of Claim 1 defines a method for producing medical preparations or precursors thereof.

Page 7, lines 1-7, of the description indicate that the following features are essential for the definition of the invention:

the extrusion parameters must be chosen such that the medical preparation or its precursor has the following properties:

- (1) amorphous or partly amorphous matrix
- (2) swellable and water-insoluble matrix.

Because independent Claim 1 does not contain these features it does not meet the requirements of PCT Article 6 combined with PCT Rule 6.3(b), according to which each independent claim must contain all the technical features that are essential for the definition of the invention.

The same objection is raised with respect to Claims 10 and 19.

- 1.2 The expression "essential properties" has no clearly defined meaning. As a rule, relative terms (essential) may not be used to delimit a technical feature over the prior art.

- 1.3 The "properties" of a matrix can take many different forms. Physical parameters (for example, density, crystallinity, melting temperature), possible drug

## VIII. Certain observations on the international application

release profiles and chemical parameters (for example, degree of oxidation, chain length and/or degree of branching of polymers) are all properties of a matrix. Every extrusion will change some of the properties of the matrix.

- 1.4 Claim 1 does not meet the requirements of PCT Article 6 because the subject matter for which protection is sought is not clearly defined. The claim attempts to define its subject matter in terms of the result to be achieved, and in doing so merely states the problem to be addressed.

09/980727

JC13 Rec'd PCT/PTO 17 OCT 2001

**ENGLISH TRANSLATION OF THE ANNEX TO THE  
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**



**English Translation of the Annex to the International Preliminary  
Examination Report**

**CLAIMS**

1. Method for producing pharmaceutical dosage forms or precursors thereof by means of extrusion, characterized in that, the dosage form has a matrix in which the active agent is essentially contained and which comprises a polysaccharide and/or a derivative thereof and/or a complex thereof and/or any mixture of the aforementioned substances with other substances and/or saccharides and/or derivatives thereof as an essential constituent, and at least one pharmaceutically active agent, and which is formed in its essential properties with regard to the release of the active agent by coextrusion with the active agent.
9. Method according to any one of the preceding claims, characterized in that, at least one pharmaceutically active agent is present in the matrix in dissolved, solid or liquid form.
10. Pharmaceutical dosage form, comprising a matrix in which the active agent is essentially contained and which comprises a polysaccharide and/or a derivative thereof and/or a complex thereof and/or any mixture of the aforementioned substances with other substances and/or saccharides and/or derivatives thereof as the essential constituent of the matrix, and at least one pharmaceutically active agent, and which is formed in its essential properties with regard to the release of the active agent by coextrusion with the active agent.
18. Dosage form according to any one of claims 10 to 17, characterized in that, at least one pharmaceutically active agent is present in the matrix in dissolved, solid or liquid form.

09/980727

C13 Rec'd PCT/PTO 17 OCT 2001

■ MARCA DE PATENTENWALIS OMIBI ■

**PCT/EP00/03612**

**EUROCELTIQUE S.A.**

**ENGLISH TRANSLATION OF WO-PUBLICATION WO 00/64415**

**PCT/EP00/03612**

**EUROCELTIQUE S.A.**

**ENGLISH TRANSLATION OF THE CLAIMS ON WHICH THE APPLICATION  
SHOULD BE BASED (CONTAINING THE AMENDMENTS OF IPER, NEW  
CLAIMS 1, 9, 10, 18)**